

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2005年4月14日 (14.04.2005)

PCT

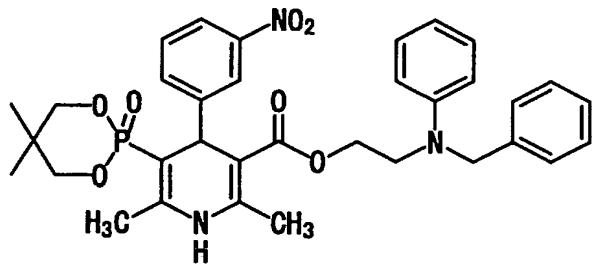
(10)国際公開番号  
WO 2005/033117 A1

(51)国際特許分類<sup>7</sup>: C07F 9/6574, C07B 57/00 // C07M 7:00  
(21)国際出願番号: PCT/JP2004/011607  
(22)国際出願日: 2004年8月12日 (12.08.2004)  
(25)国際出願の言語: 日本語  
(26)国際公開の言語: 日本語  
(30)優先権データ: 特願2003-342761 2003年10月1日 (01.10.2003) JP  
(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo (JP).  
(72)発明者; および  
(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 高田 泰孝 (TAKADA, Yasutaka) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 松本 浩郎 (MATSUMOTO, Hiroo) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP).  
(74)代理人: 尊 経夫, 外(HANABUSA, Tsuneo et al.); 〒1010062 東京都千代田区神田駿河台3丁目2番地 新御茶ノ水アーバントリニティ 尊特許事務所内 Tokyo (JP).  
(81)指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.  
(84)指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(続葉有)

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE DIHYDROPYRIDINEPHOSPHONIC ESTER

(54)発明の名称: 光学活性なジヒドロピリジンホスホン酸エステルの製造方法



(1)

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a process for efficiently producing an optically active isomer of efonidipine, the isomer being useful as an antihypertensive agent or a therapeutic agent for angina pectoris. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] The process, which is for producing an optically active isomer of the compound represented by the formula (1), [Chemical formula 1] (1) is characterized in that a racemate of

the compound represented by the formula (1) is dissolved in a solvent to prepare a supersaturated solution and crystals of one of the optically-active isomers of the compound represented by the formula (1) are added as seed crystals to the supersaturated solution to precipitate crystals of the optically active isomer whose seed crystals were added, or that a mixture of optically active isomers of the compound represented by the formula (1) in which either of the isomers is present in excess is dissolved in a solvent to prepare a supersaturated solution and crystals of the optically active isomer which is present in excess are added as seed crystals to the supersaturated solution to precipitate crystals of the optically active isomer present in excess.

(57) 要約: 【課題】抗高血圧薬、狭心症治療薬として有用な、エホニジピンの光学活性体の効率的な製造方法を提供する。【解決手段】式(1)で表される化合物のラセミ体を溶媒に溶解して過飽和溶液を調製し、前記過飽和溶液に、前記式(1)で表される化合物の、どちらか一方の光学活性体の結晶を種晶として加え、前記種晶を加えた一方の光学活性体の結晶を析出させるか、又は、前記式(1)で表される化合物の、どちらか一方の光学活性体が過剰に存在する混合体を溶媒に溶解して過飽和溶液を調製し、前記過飽和溶液に、過剰に存在する一方の光学活性体の結晶を種晶として加え、前記過剰に存在する一方の光学活性体の結晶を析出させることを特徴とする、式(1)で表される化合物の光学活性体の製造方法。

WO 2005/033117 A1



添付公開書類:

— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。